

訂正版

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 3 月 31 日 (31.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/028438 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 211/58, 401/06, 401/14,  
401/02, 401/12, 409/12, A61K 31/4545, 31/496, 31/454,  
31/4523, 31/4535, 31/506, A61P 43/00, 3/04, 3/10, 5/00,  
3/06, 19/06, 9/10, 9/04, 9/12, 13/12, 25/20, 25/24, 25/22,  
25/08, 25/18, 25/28, 25/16, 25/02, 25/32, 25/36

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/013768

(22) 国際出願日: 2004 年 9 月 21 日 (21.09.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-330758 2003 年 9 月 22 日 (22.09.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.)  
[JP/JP]; 〒1038416 東京都中央区日本橋本町二丁目  
2 番 3 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 大嶽 憲一  
(OHTAKE, Norikazu) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 水谷 清香 (MIZUTANI, Sayaka)  
[JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 善本 亮 (YOSHIMOTO, Ryo) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つく

くば市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 鴫田 滋 (TOKITA, Shigeru) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 金谷 章生 (KANATANI, Akio) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 廣田 雅紀, 外 (HIROTA, Masanori et al.); 〒1070052 東京都港区赤坂二丁目 8 番 5 号 若林ビル 3 階 Tokyo (JP).

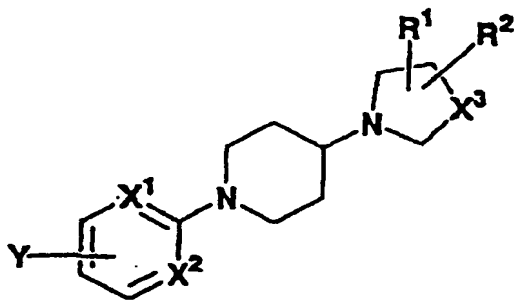
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

(54) Title: NOVEL PIPERIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規ピペリジン誘導体



(I)

(57) Abstract: A histamine H3-receptor antagonist; and a therapeutic and/or preventive agent for metabolic diseases, e.g., obesity and diabetes, various diseases such as, e.g., angina pectoris and acute/congestive heart failure, circulatory diseases such as, e.g., idiopathic narcolepsy and recurrent narcolepsy, and central and peripheral nerve diseases such as, e.g., bulimia, affective disorders, and depression. The histamine

H3-receptor antagonist is characterized by containing a piperidine derivative represented by the general formula (I) [wherein X<sup>1</sup> and X<sup>2</sup> each independently represents nitrogen or CH; Y represents a specific group; X<sup>3</sup> represents O<sub>s</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>; R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> each independently represents hydrogen, halogeno, linear or branched lower alkyl, lower alkoxy, or acetyl substituted by 2 or 3 fluorine atoms; s is 0 or 1; and m is such an integer that (m+s) is 0 to 4] or a pharmaceutically acceptable salt of the derivative.

[続葉有]



添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

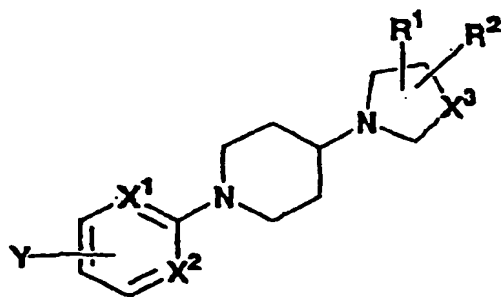
(48) この訂正版の公開日: 2005年5月26日

(15) 訂正情報:  
PCTガゼットセクションIIのNo.21/2005(2005年5月26日)を参照

(57) 要約:

ヒスタミンH<sub>3</sub>受容体アンタゴニストを提供し、肥満症、糖尿病、等の代謝系疾患、例えば狭心症、急性・うつ血性心不全等の各種疾患、例えば特発性過眠症、反復性過眠症等の循環器系疾患、例えば過食症、情動障害、うつ病等の中枢及び末梢神経系疾患の治療剤及び／又は予防剤を提供するものである。一般式(I)〔式中、X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は独立して窒素原子又はCHを示し、Yは特定の基を示し、X<sup>3</sup>はO、—(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>を示し、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、独立して水素原子、ハロゲン原子、直鎖若しくは分岐の低級アルキル基、低級アルコキシ基、又は2若しくは3のフッ素原子で置換されたアセチル基を示し、sは0又は1を示し、mは(m+s)が0又は1～4となる整数を示す。〕で表されるピペリジン誘導体化合物又はその薬学的に許容される塩を含有することを特徴とするヒスタミンH<sub>3</sub>受容体アンタゴニスト。

【化1】



(1)